

⑤ Int. Cl.
C 07 d 57/04
A 61 k 27/00
A 61 k 15/12
C 07 d 31/32

⑤ 日本分類
16 E 611
30 B 0
30 B 4
30 B 223
16 E 431

⑨ 日本国特許庁

⑪ 特許出願公告

昭48-21959

特 許 公 報

④ 公告 昭和48年(1973)7月2日

発明の数 1

(全1頁)

1

⑤ ジニコチニルピリドキサールおよびその塩の製法

⑥ 特 願 昭44-24582

⑦ 出 願 昭40(1965)6月15日

⑧ 特 願 昭40-35589の分割

⑨ 発 明 者 吉村嘉男

西宮市高座町200の6

同 宇野準

高槻市真上町1の17の7

同 入江明

大阪市東淀川区塚本町6の11の3

⑩ 出 願 人 大日本製薬株式会社

大阪市東区道修町3の25

⑪ 代 理 人 弁理士 坪井有四郎

発明の詳細な説明

本発明は、ビタミンB₆類の1種であるピリドキサールの2個の水酸基にニコチン酸が結合したピリドキサールのニコチン酸誘導体の製法に関する。

本発明者等は、ピリドキサールまたはその鉍酸塩に、ニコチン酸クロライド塩酸塩を作用せしめると、その2個の水酸基とニコチン酸とがエステル型に結合し、そのジニコチニル誘導体を得られることを見出し、本発明を完成した。

本発明方法で得られるピリドキサールのニコチン酸誘導体は、新規物質であり、喘息、糖尿病、皮膚炎、神経炎等の治療に効果を有し、特にビタミンB₆。およびニコチン酸の個々の作用を持続性にする点に特徴を有している。例えばニコチン酸の単独投与では、作用が急激なため顔面、頭部、手足の皮膚が一時的に紅潮するが、ピリドキサールのニコチン酸誘導体では作用が徐々に現われ持

2

続的であるのでこのようなことはみられない。

本発明方法の実施は、ピリドキサールまたはその鉍酸塩にニコチン酸クロライド塩酸塩を脱塩酸剤の存在下に適当な溶媒中で反応せしめることにより進められる。脱塩酸剤として一般に適当なものはビリジン、ピコリン、トリメチルアミン、トリエチルアミン等の塩基である。反応に使用される溶媒としてはクロロホルム、ジオキサン、ベンゼン等の有機溶媒が好ましく、脱塩酸剤に溶媒を兼ねさして多量に使用してもよい。

次に実施例を挙げて本発明方法をさらに具体的に説明する。

実施例

ピリドキサール塩酸塩 1.4 g およびニコチン酸クロライド塩酸塩 2.5 g (ニコチン酸とチオニルクロライドとを反応させて調製したものを直ちに使用) をクロロホルム 30 ml に浮遊させ、攪拌しながらビリジン 30 ml を適加する。室温で3時間攪拌後ビリジン塩酸塩を濾去し、溶媒を減圧で留去し、残渣をクロロホルムで抽出する。クロロホルム層を 0.5 N 塩酸、5% 炭酸水素ナトリウム水、水の順に洗つて、芒硝で乾燥し、クロロホルムを留去する。残渣をエタノールに溶解しエーテルを加えて析出する結晶を濾取して、3・4 α-O-ジニコチニルピリドキサール 0.4 g を得る。

融点 118~119℃

元素分析 C₂₀H₁₅N₃O₅

	C	H	N
計算値	63.66	4.01	11.14
実験値	63.37	4.03	10.93

⑫ 特許請求の範囲

1 ピリドキサールまたはその鉍酸塩にニコチン酸クロライド塩酸塩を脱塩酸剤の存在下に反応せしめることを特徴とするジニコチニルピリドキサールおよびその塩の製法。